

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 09-040689

(43)Date of publication of application : 10.02.1997

(51)Int.Cl.

C07J 63/00

A23L 1/30

A61K 31/56

A61K 31/56

C12N 9/99

(21)Application number : 08-118784

(71)Applicant : NIPPON FLOUR MILLS CO LTD

(22)Date of filing : 14.05.1996

(72)Inventor : UCHINO KEIJIRO  
MIZUNO TAKASHI  
KAWAGUCHI KIYOMI

(30)Priority

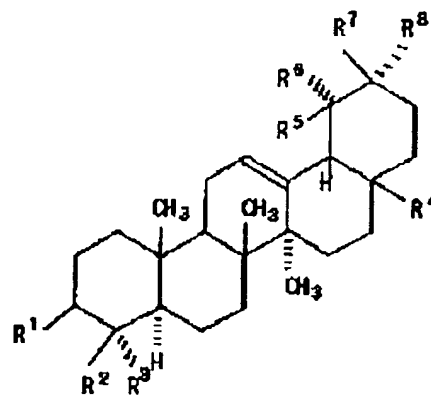
Priority number : 07124909 Priority date : 24.05.1995 Priority country : JP

## (54) INHIBITOR OF LIPASE

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain an inhibitor of a lipase, having high safety and high inhibiting activities against the lipase and capable of preventing a food from deteriorating by blending at least one of a compound of triterpenes and its derivative, etc., as an active ingredient.

SOLUTION: This inhibitor of a lipase is obtained by blending a compound of triterpenes of the formula [R<sup>1</sup> is OH or OC(O)CH<sub>3</sub>; R<sup>2</sup> to R<sup>4</sup> are each H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, COOH or CHO; R<sup>5</sup> to R<sup>8</sup> are each H or CH<sub>3</sub>] and its derivatives such as their salts or acetylated substances thereof, concretely at least one of a compound comprising oleanolic acid, ursonic acid, their salts and acetylated substances thereof as an active ingredient. The inhibitor of the lipase is prepared by mixing the active ingredient with eggshell calcium, ferric pyrophosphate, ascorbic acid, etc., in a mixer, etc., according to a conventional method, then tableting the resultant mixture and formulating the mixture into a pharmaceutical preparation. The resultant inhibitor has high safety and high activities against the lipase and is capable of preventing a food containing an oil and a fat from deteriorating due to the lipase and reducing the calorie of the food and useful even for prevention, etc., of adult diseases.



## LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 14.01.2003

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than

the examiner's decision of rejection or  
application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision  
of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's  
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平9-40689

(43) 公開日 平成9年(1997)2月10日

(51) Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 J 63/00			C 0 7 J 63/00	
A 2 3 L 1/30			A 2 3 L 1/30	Z
A 6 1 K 31/56	ADN		A 6 1 K 31/56	ADN
	AED			AED
C 1 2 N 9/99			C 1 2 N 9/99	
審査請求 未請求 請求項の数6 OL (全7頁)				

(21) 出願番号 特願平8-118784  
(22) 出願日 平成8年(1996)5月14日  
(31) 優先権主張番号 特願平7-124909  
(32) 優先日 平7(1995)5月24日  
(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000231637  
日本製粉株式会社  
東京都渋谷区千駄ヶ谷5丁目27番5号  
(72) 発明者 内野 敬二郎  
神奈川県厚木市戸室5-23-30  
(72) 発明者 水野 隆志  
神奈川県相模原市松ヶ枝町5-16  
(72) 発明者 川口 きよみ  
神奈川県小田原市久野914  
(74) 代理人 弁理士 中村 総 (外7名)

(54) 【発明の名称】 リパーゼ阻害剤

(57) 【要約】

【課題】 安全性が高く、かつ高いリパーゼ阻害活性を有するリパーゼ阻害剤を提供する。

【解決手段】 トリテルペン類化合物及びその誘導体からなる群から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有するリパーゼ阻害剤；該誘導体が塩類又はアセチル化物である上記リパーゼ阻害剤；有効成分としてオレアノール酸、ウルソン酸、それらの塩類及びそれらのアセチル化物からなる群から選ばれる少なくとも1種を含むリパーゼ阻害剤；上記のリパーゼ阻害剤を含有する食品添加物；上記のリパーゼ阻害剤又は食品添加物を配合した食品。

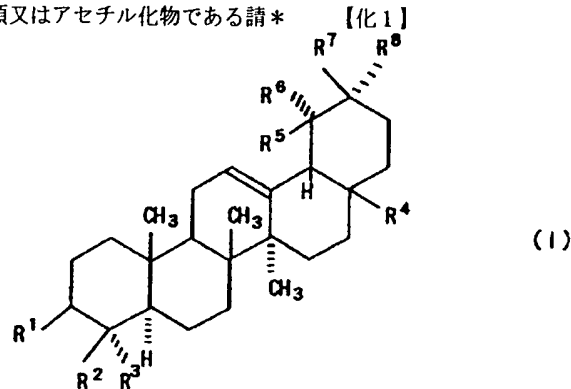
## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 トリテルペン類化合物及びその誘導体からなる群から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有するリパーゼ阻害剤。

【請求項2】 誘導体が塩類又はアセチル化物である請\*

\* 求項1記載のリパーゼ阻害剤。

【請求項3】 トリテルペン類化合物又はそのアセチル化物が下記一般式(1)で示される請求項1又は2記載のリパーゼ阻害剤。



(式中、 $R^1$  は $-OH$ または $-OC(O)-CH_3$ を表し、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ はそれぞれ独立して水素原子、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-COOH$ または $-CHO$ を表し、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ はそれぞれ独立して水素原子または $-CH_3$ を表す。)

【請求項4】 有効成分としてオレアノール酸、ウルソン酸、それらの塩類及びそれらのアセチル化物からなる群から選ばれる少なくとも1種を含む、請求項1〜3のいずれか1項に記載のリパーゼ阻害剤。

【請求項5】 請求項1〜4のいずれか1項記載のリパーゼ阻害剤を含有する食品添加物。

【請求項6】 請求項1〜4のいずれか1項記載のリパーゼ阻害剤又は請求項5に記載の食品添加物を配合した食品。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は、リパーゼ阻害剤、詳しくはトリテルペン類化合物又はそれらの誘導体を有効成分として含有するリパーゼ阻害剤に関する。さらに、そのリパーゼ阻害剤を含む食品添加物、それらを配合した食品に関する。

## 【0002】

【従来の技術】 食品に含まれる脂肪は、その食品原料に含まれているリパーゼや、食品中に混入した微生物由来のリパーゼにより加水分解を受け、グリセロールと遊離脂肪酸に分解される。この遊離脂肪酸は、変敗や悪臭の原因となり、食品の品質保持の観点から遊離脂肪酸の発生を抑制することが重要な課題となっている。また、近年、栄養過多等の原因による種々の成人病が増加している。このような成人病のうち、特に糖尿病、高脂血症、肥満などの予防や治療を目的として、リパーゼ阻害剤といった消化酵素に対する阻害剤が注目されてきている。さらに、食品にあらかじめ酵素に対する阻害剤を配合しておく方法が考えられている。今まで、ホスファチ

ジルコリン (K. Taniguti 等、Bull. Facul. Agric. Meiji Univ., 73 巻, 9~26頁 (1986年))、大豆蛋白 (K. Satouchi 等、Agric. Biol. Chem., 38巻, 97~101頁 (1974年); K. Satouchi等、Agric. Biol. Chem., 40巻, 889~897 頁 (1976年))、タンニン (S. Ahimura等、日食工 41巻, 561~564 頁 (1994年))、シャクヤク、オオレン、オオバク、ボタンビ、ゲンノショウコ、チャ、クジンなどの生薬の溶媒抽出エキス (特開昭64-90131号公報)、ピーマン、かぼちゃ、しめじ、まいたけ、ひじき、緑茶、紅茶及びウーロン茶の水抽出物 (特開平3-219872号公報)、ドクカツ、リョウキョウ、ビンロウシ、ヨバイヒ、サンペズ、ケツメイシの抽出物 (特開平5-255100号公報) などが、リパーゼ阻害活性を有するものとして知られているが、未だ十分な効果は得られていない。

## 【0003】

【発明が解決しようとする課題】 本発明の目的は、優れたリパーゼ阻害活性を示し、かつ安全性の高いリパーゼ阻害剤を提供することである。本発明の目的はまた、上記リパーゼ阻害剤を含む食品添加物を提供し、さらに、それらのリパーゼ阻害剤あるいは食品添加物を配合した食品を提供することである。

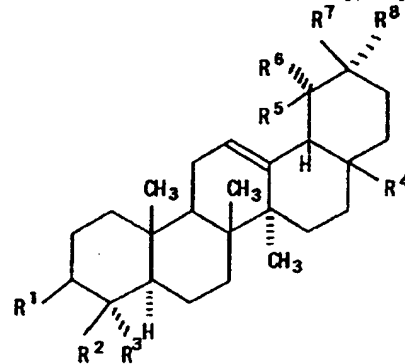
## 【0004】

【課題を解決するための手段】 上記目的を達成するために、本発明者らは、安全性、有効性の点で問題点を有しない新規なリパーゼ阻害物質を見出すべく鋭意研究した結果、植物成分として知られているトリテルペン類化合物及びその誘導体が強いリパーゼ阻害活性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。従って本発明は、トリテルペン類化合物及びその誘導体からなる群から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有するリパーゼ阻害剤に関する。該誘導体としては具体的に、塩類及びアセチル化物が挙げられ、特にアセチル化物は溶媒への溶解性が良好な点で優れている。本発明の好まし

い実施態様として、有効成分としてオレオノール酸、ウルソノ酸、それらの塩類及びそれらのアセチル化物からなる群から選ばれる少なくとも1種を含むリパーゼ阻害剤が挙げられる。本発明はまた、上記リパーゼ阻害剤を含有する食品添加物に関する。本発明はさらに、上記リパーゼ阻害剤又は食品添加物を配合した食品に関する。

## 【0005】

【発明の実施の形態】トリテルペン類化合物は、植物界\*



(1)

【0007】(式中、R<sup>1</sup> は-OHまたは-OC(O)-CH<sub>3</sub>を表し、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立して水素原子、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、-COOHまたは-CHOを表し、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>はそれぞれ独立して水素原子または-CH<sub>3</sub>を表す。)

上記一般式で示される更なる具体例として、オレオノール酸、ウルソノ酸及びそれらのアセチル化物が挙げられる。オレオノール酸やウルソノ酸をアセチル化することにより、エタノール、メタノールやクロロホルムとい

※た通常有機溶媒に対する溶解性を向上させることができ、且つ、より強いリパーゼ阻害活性が示される。溶解性の向上は、研究上、及び生体吸収性等の観点から好ましい。本発明のリパーゼ阻害剤の有効成分であるトリテルペン類化合物及びそれらの誘導体の具体例は、上記一般式(1)において次のように示される。

## 【0008】

## 【表1】

一般式(1)								
化合物名	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
オレオノール酸	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COOH	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>
オレオノール酸の アセチル化物	-OC(O)-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COOH	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>
ウルソノ酸	-OH	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COOH	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>
ウルソノ酸の アセチル化物	-OC(O)-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COOH	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>

【0009】オレオノール酸(Oleanolic acid)はβ-アミリン系トリテルペン的一种であって、各種植物に含まれている。例えばオリーブ葉、センブリ、チョウジ、ブドウ果皮に遊離状態で含まれていて、チクセツニンジン、ニンジン、サトウダイコンなどにはサポニンとして存在し、酸加水分解からも得られる。また、オレオノール酸は青じそに含まれていることが知られている。オレオノール酸について、抗癌作用、抗炎症作用、抗リウマチ作用、抗糖尿病作用(特開昭55-122715号公報)、発癌プロモーター抑制作用(特開昭63-57519号公報)、う蝕予防作用(特開昭61-3621

3号公報)が既に知られている。一方ウルソノ酸(Ursolic acid)はウルソール酸ともいい、α-アミリン系トリテルペン的一种である。ウルソノ酸はリンゴ、サクランボなどの種々の果実や葉の表面のろう状物質などの中に存在する。オレオノール酸、ウルソノ酸は極めて毒性の低いものと考えられる。

【0010】本発明で使用する有効成分は、上記植物から抽出される天然品でも、あるいは合成品でもよい。これらの有効成分の合成は、常法に従って実施することができる。また有効成分として、植物からの抽出液ないし抽出物など未精製物状態で使用してもよい。本発明で使

\*に広く遊離基として存在し、または糖と結合してサポニン、酸と結合してエステルとして分布している。それらは極めて毒性の低いものと考えられる。本発明のリパーゼ阻害剤の有効成分であるトリテルペン類化合物及びそのアセチル化物としては、例えば下記一般式(1)で示される化合物が挙げられる。

## 【0006】

## 【化2】

用する有効成分としては市場で一般に入手できるものがあり、本発明ではそのような市販品を使用することができる。また本発明のリパーゼ阻害剤の有効成分として、上記トリテルペン類化合物の塩類、例えば一般式(1)における-COOHから誘導される塩類を使用することができる。さらに具体的にオレアノール酸、ウルソン酸の塩類が挙げられる。それらの塩類としてはリパーゼ阻害活性を有するものであればよい。例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、リチウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、バリウム塩、テトラブチルアンモニウム塩などが挙げられる。オレアノール酸、ウルソン酸等がリパーゼを阻害することは、今まで知られていなかった。

#### 【0011】参考例1

オレアノール酸及びウルソン酸のアセチル化  
オレアノール酸100mgにピリジン10mlと無水酢酸5.0mlを加え、暗所にて反応させた。反応液を6N H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>によりpH2付近に調整し、酢酸エチルで抽出した。飽和NaHCO<sub>3</sub>とイオン交換水で洗浄、精製した。酢酸エチル層を濃縮乾固しアセチル化物の粉末を得た。ウルソン酸も同様にアセチル化を行った。ここで製造したオレアノール酸のアセチル化物及びウルソン酸のアセチル化物を、シリカゲル薄層クロマトグラフィーにて検討した。展開溶媒は、ヘキサン：メタノール=20：1を用いた。その結果を下表に示す。

#### \*【0012】

##### 【表2】

化合物	R F 値
オレアノール酸	0.46
ウルソン酸	0.48
オレアノール酸のアセチル化物	0.68
ウルソン酸のアセチル化物	0.70

#### 【0013】試験例1

##### 溶解性について

オレアノール酸(シグマ社製)、ウルソン酸(シグマ社製)、オレアノール酸のアセチル化物(参考例1で得られたもの)、ウルソン酸のアセチル化物(参考例1で得られたもの)を使用して、各検体100mgに各溶媒10mlを加え攪拌後、溶解性を観察した。評価は次のとおりである。結果を下記表3に示す。

×：攪拌後、溶解しなかった。

△：攪拌後、半分ほど溶解した。

○：攪拌後、完全に溶解した。

◎：溶媒を添加した直後に溶解した。

#### 【0014】

##### 【表3】

化合物名	溶媒		
	エタノール	メタノール	クロロホルム
オレアノール酸	×	×	△
オレアノール酸のアセチル化物	×	×	×
ウルソン酸	△	○	◎
ウルソン酸のアセチル化物	△	○	◎

#### 【0015】試験例2

本発明の有効成分であるオレアノール酸、ウルソン酸のリパーゼ阻害活性について試験を行った。その方法及び結果を説明する。オレアノール酸(シグマ社製)、ウルソン酸(シグマ社製)を使用して、各種濃度のオレアノール酸溶液、ウルソン酸溶液を調製した。基質溶液として0.1mMの4-メチルウンベリフェリルオレエートを含むMcIlvaine緩衝液(0.1M、pH7.4)を使用し、酵素として豚膵臓由来リパーゼ(シグマ社製)を使用した。基質溶液0.1ml、オレアノール酸溶液あるいはウルソン酸溶液10μl、適量の豚膵臓由来リパーゼ及びMcIlvaine緩衝液で全量を0.2mlとして、37℃で20分間酵素反応させた。反応後、0.1N HCl 1.0mlを反応液に加えて酵素※

※反応を止め、次にクエン酸ナトリウム溶液で反応液をpH4.3に調整した後、リパーゼにより基質から生成した4-メチルウンベリフェロンの蛍光を励起波長320nm、蛍光波長450nmで定量した。なお、対照として、オレアノール酸溶液やウルソン酸溶液を無添加で同様に試験した。各検体における阻害率(%)を、[(対照の蛍光強度-各検体の蛍光強度)/対照の蛍光強度]×100より求めた。その結果、下記表4のとおり、オレアノール酸及びウルソン酸は、12.5μg/mlで各々43%、59%というリパーゼ阻害率を示した。

#### 【0016】

##### 【表4】

オレアノール酸の 添加量(μg/ml)	阻害率 (%)	ウルソン酸の 添加量(μg/ml)	阻害率 (%)

7			8
100	99	100	98
50	95	50	97
25	74	25	80
12.5	43	12.5	59

## 【0017】試験例3

豚膵臓由来リパーゼをシュドモナス (Pseudomonas) 由来リパーゼ (シグマ社製) にかえて、上記試験例2と同様に試験した。その結果、下表のとおり、オレアノール\*

※ル酸及びウルソン酸は、12.5  $\mu$ g/ml で各々47%、57%というリパーゼ阻害率を示した。

## 【0018】

## 【表5】

オレアノール酸の 添加量 ( $\mu$ g/ml)	阻害率 (%)	ウルソン酸の 添加量 ( $\mu$ g/ml)	阻害率 (%)
100	97	100	98
50	88	50	97
25	56	25	65
12.5	47	12.5	57

## 【0019】試験例4

本発明の有効成分であるオレアノール酸のアセチル化物、ウルソン酸のアセチル化物のリパーゼ阻害活性について試験を行った。参考例1で得られたオレアノール酸のアセチル化物、ウルソン酸のアセチル化物を使用して、各種濃度の検体溶液を調製した。基質溶液として0.1mMの4-メチルウンベリフェリルオレエートを含むMcIlvaine 緩衝液 (0.1M、pH7.4) を使用し、酵素として豚膵臓由来リパーゼ (シグマ社製) を使用した。基質溶液 0.1ml、検体溶液 10  $\mu$ l、適量の豚膵臓由来リパーゼ及びMcIlvaine 緩衝液で全量を0.2mlとして、37°Cで20分間酵素反応させた。反応後、0.1NHCl 1.0ml を反応液に加えて酵素反応を止め、次にクエン酸ナトリウム溶※

※液で反応液をpH4.3に調整した後、リパーゼにより基質から生成した4-メチルウンベリフェロンの蛍光を励起波長 320nm、蛍光波長 450nmで定量した。なお、対照として、検体溶液を無添加で同様に試験した。各検体における阻害率(%)を、[(対照の蛍光強度-各検体の蛍光強度)/対照の蛍光強度]  $\times$  100より求めた。その結果、下記表6のとおり、オレアノール酸のアセチル化物、ウルソン酸のアセチル化物は、12.5  $\mu$ g/mlで各々、67%及び40%というリパーゼ阻害率を示した。5.0%阻害濃度 (IC<sub>50</sub>) はそれぞれ、8.33  $\mu$ g/ml、及び16.93  $\mu$ g/mlであった。

## 【0020】

## 【表6】

オレアノール酸のアセチル化物 の添加量 ( $\mu$ g/ml)	阻害率 (%)	ウルソン酸のアセチル化物 の添加量 ( $\mu$ g/ml)	阻害率 (%)
25	76	50	80
12.5	67	25	63
6.25	39	12.5	40

## 【0021】試験例5

豚膵臓由来リパーゼをシュドモナス (Pseudomonas) 由来リパーゼ (シグマ社製) にかえて、上記試験例4と同様に試験した。その結果、下記表7のとおり、オレアノール酸のアセチル化物、ウルソン酸のアセチル化物 ★

40★は、12.5  $\mu$ g/mlで各々、88%及び55%というリパーゼ阻害率を示した。5.0%阻害濃度 (IC<sub>50</sub>) はそれぞれ、4.44  $\mu$ g/ml、及び10.45  $\mu$ g/mlであった。

## 【0022】

## 【表7】

オレアノール酸のアセチル化物 の添加量 ( $\mu$ g/ml)	阻害率 (%)	ウルソン酸のアセチル化物 の添加量 ( $\mu$ g/ml)	阻害率 (%)
25	89	50	95
12.5	88	25	86

【0023】本発明のリパーゼ阻害剤は、その有効成分であるトリテルペン類化合物やその誘導体の他に添加剤を含んでもよい。またそれらの有効成分は適当な助剤とともに任意の形態に製剤化して、経口または非経口投与が可能なリパーゼ阻害剤とすることができる。さらに、本発明のリパーゼ阻害剤は、他の有効成分を含んでいてもよい。

【0024】以下に、本発明のリパーゼ阻害剤の投与方法、投与量及び製剤化の方法を示す。本発明のリパーゼ阻害剤は、経口及び非経口投与のいずれも使用可能であり、経口投与する場合は、軟・硬カプセル剤又は錠剤、顆粒剤、細粒剤、散剤として投与される。非経口投与する場合は、注射剤、点滴剤及び固体状または懸濁粘稠液状として持続的な粘膜吸収が維持できるように坐薬のような剤型で投与され得るが、局所組織内投与、皮内、皮下、筋肉内及び静脈内注射、局所への塗布、噴霧、坐剤、膀胱内注射などの外用的投与方法等も用いることができる。投与量は、投与方法と病気の悪性度、患者の年齢、病状や一般状態、病気の進行度等に依って変化し得るが、大人では通常、1日当たり有効成分として0.5～5,000mg、小人では通常、0.5～3,000mgが適当である。本発明のリパーゼ阻害剤の有効成分の割合は、剤型によって変更され得るが、通常、経口または粘膜吸収に投与されるとき、約0.3～15.0重量%が適当であり、非経口投与されるときは、ほぼ0.01～10重量%が適当である。また、本発明のリパーゼ阻害剤の製剤化に当たっては、常法に従い、水溶液、油性製剤などにして、皮下あるいは静脈注射用製剤とすることができる。他、カプセル剤、錠剤、細粒剤等の剤型に製剤化して経口用に供することができる。

【0025】また、有効成分に長時間の保存に耐える安定性及び耐酸性を付与して薬効を完全に持続させるために、更に医薬的に許容し得る被膜を施して製剤化すれば、すぐれた安定性を有するリパーゼ阻害剤とすることができる。本発明のリパーゼ阻害剤の製剤化に用いられる界面活性剤、賦形剤、滑沢剤、佐剤及び医薬的に許容し得る被膜形成物質等を挙げれば、次の通りである。本発明のリパーゼ阻害剤の崩壊、溶出を良好ならしめるために、界面活性剤、例えばアルコール、エステル類、ポリエチレングリコール誘導体、ソルビタンの脂肪酸エステル類、硫酸化脂肪アルコール類等の1種又は2種以上を添加することができる。また、賦形剤として、例えば、蔗糖、乳糖、デンプン、結晶セルロース、マンニト、軽質無水珪酸、アルミン酸マグネシウム、メタ珪酸アルミン酸マグネシウム、合成珪酸アルミニウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸水素カルシウム、カルボキシメチルセルロースカルシウム等の1種又は2種以上を組み合わせ添加することができる。

【0026】滑沢剤としては、例えばステアリン酸マグネシウム、タルク、硬化油等を1種または2種以上添加することができ、また矯味剤及び矯臭剤として、食塩、サッカリン、糖、マンニト、オレンジ油、カンゾウエキス、クエン酸、ブドウ糖、メントール、ユーカリ油、リンゴ酸等の甘味剤、香料、着色剤、保存料等を含有させてもよい。懸濁剤、湿潤剤のような佐剤としては、例えば、ココナッツ油、オリーブ油、ゴマ油、落花生油、乳酸カルシウム、ペニバナ油、大豆リン脂質等を含有させることができる。また、被膜形成物質としては、セルロース、糖類等の炭水化物誘導体として酢酸フタル酸セルロース(CAP)、またアクリル酸系共重合体、二塩基酸モノエステル類等のポリビニル誘導体としてアクリル酸メチル・メタアクリル酸共重合体、メタアクリル酸メチル・メタアクリル酸共重合体が挙げられる。また、上記被膜形成物質をコーティングするに際し、通常使用されるコーティング剤、例えば可塑剤の他、コーティング操作時の薬剤相互の付着防止のための各種添加剤を添加することによって被膜形成剤の性質を改良したり、コーティング操作をより容易ならしめることができる。

【0027】本発明のリパーゼ阻害剤はまた、食品、健康食品に配合することができ、食品添加物の成分とすることもできる。食品中に配合する場合は、食品に対して有効成分として0.001～15重量%、特に0.01～10重量%配合することが好ましいが、食品の種類によって、上記の範囲よりも少なく、または多く配合することができる。例えば、錠剤やビスケット等の補助食用の食品に配合するときは、15重量%以上配合させることができる。食品に応じて、その製造過程で本発明のリパーゼ阻害剤を適宜配合することができる。本発明のリパーゼ阻害剤あるいは食品添加物を配合させる食品の種類はいかなるものであってもよく、例えば、パン、麺、ビスケット、ホットケーキ、錠剤等の穀粉や澱粉を含有する食品の他、ドレッシング、ドリンク等を挙げることができる。

#### 【0028】

【実施例】以下、実施例により本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの記載に限定されるものではない。

##### 実施例1 (錠剤及び錠剤)

卵殻カルシウム108g、ピロリン酸第二鉄2g、アスコルビン酸40g、微結晶セルロース40g、還元麦芽糖285g、オレアノール酸0.5gをミキサーによって常法により混和した後、打錠し、錠剤及び錠剤を製造した。

##### 実施例2 (錠剤及び錠剤)

卵殻カルシウム108g、ピロリン酸第二鉄2g、アスコルビン酸40g、微結晶セルロース40g、還元麦芽



糖285g、オレアノール酸のアセチル化物0.5gをミキサーによって常法により混和した後、打錠し、錠剤及び錠剤を製造した。

【0029】実施例3 (ビスケット)

小麦粉120g、ウルソン酸0.12g、砂糖35g、ショートニング15g、全卵粉1.5g、食塩1g、炭酸水素ナトリウム0.6g、炭酸アンモニウム0.75g、水20gを用いて、常法によりドウを作成し、成型、焙焼してビスケットを製造した。

実施例4 (ビスケット)

小麦粉120g、オレアノール酸のアセチル化物0.12g、砂糖35g、ショートニング15g、全卵粉1.5g、食塩1g、炭酸水素ナトリウム0.6g、炭酸アンモニウム0.75g、水20gを用いて、常法によりドウを作成し、成型、焙焼してビスケットを製造した。

【0030】実施例5 (パン)

小麦粉3kg、オレアノール酸30g、イースト60g、イーストフード3g、砂糖150g、食塩60g、ショートニング150g、脱脂粉乳60g、水2070gを用いて、常法によりドウを作成し、成型、焙焼してパンを製造した。

実施例6 (パン)

小麦粉3kg、ウルソン酸のアセチル化物30g、イース

ト60g、イーストフード3g、砂糖150g、食塩60g、ショートニング150g、脱脂粉乳60g、水2070gを用いて、常法によりドウを作成し、成型、焙焼してパンを製造した。

【0031】実施例7 (麺)

準強力小麦粉に対して、1重量%のウルソン酸、34重量%の水、1重量%の食塩及び1重量%のかんづんを加えたものを、12分間混捏した後、麺機にて数回圧延、成形して、中華麺の生麺帯、生麺線を得た。

10 実施例8 (麺)

準強力小麦粉に対して、1重量%のオレアノール酸のアセチル化物、34重量%の水、1重量%の食塩及び1重量%のかんづんを加えたものを、12分間混捏した後、麺機にて数回圧延、成形して、中華麺の生麺帯、生麺線を得た。

【0032】

【発明の効果】本発明のリパーゼ阻害剤は、安全性が高く、かつ高いリパーゼ阻害活性を有する。油脂を含む食品のリパーゼに起因する食品の劣化を防止することができる。また食品のカロリーを減少させることができる。さらに、脂質の過剰摂取による肥満や高脂血症など、近年の食生活を反映している成人病の予防にも有用である。

This Page Blank (uspto)